

## Magyar cím:

Farmakológiailag aktív polipeptidok új, megnövelt és nyújtott hatású konjugátumai és az azokat tartalmazó gyógyászati készítmények

## Angol cím:

NEW CONIUGATES OF PHARMACEUTICALLY ACTIVE POLYPEPTIDES WITH ENHANCED AND PROLONGUED ACTIVITY AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING THEM

## Bejelentő:

Creighton University, Omaha, Nebraska, US  
MTA Központi Kémiai Kutatóintézet, Budapest, HU  
MTA Támogatott Kutatóhelyek Irodája, Budapest, HU  
Országos Onkológiai Intézet, Budapest, HU

## Feltaláló:

dr. Pató János, Budapest, HU  
dr. Lovas, Sándor, Omaha, Nebraska, US  
dr. Murphy, Richard F., Omaha, Nebraska, US  
dr. Móra Melinda, Budapest, HU  
dr. Pályi István, Budapest, HU  
dr. Vincze Borbála, Budapest, HU  
dr. Gaál Dezső, Budapest, HU  
dr. Mező Imre, Budapest, HU  
dr. Teplán István, Budapest, HU  
Kálnay Adrienn, Budapest, HU  
dr. Seprődi János, Budapest, HU  
dr. Turi Gizella, Budapest, HU  
dr. Vadász Zsolt, Budapest, HU  
Szabó Z. Edit, Budapest, HU

## Képviselő

DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest

$Y (W_u, V_z, X_r, A_k)$

## Kivonat:

A találmány az (I) általános képletű farmakológiailag aktív új vegyületekre és sóikra vonatkozik.

Az (I) általános képletben

Y jelentése az (Ia) általános képletű molekuláriszlet, ahol n értéke 10-400, előnyösen 20-200 közötti egész szám, R1 és R2 egyikének jelentése hidrogénatom, a másik pedig a (B) képletű csoport,

R3 jelentése a polimerizációt iniciáló csoport, előnyösen (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CCN;

W jelentése hidroxil csoport, amely alkálifémionokkal, előnyösen nátriumionokkal sóvá lehet alakítva;

V jelentése az aminosocsoportján keresztül kapcsolódó 1-8, előnyösen 4-6 szénatomos alkil-amin csoport, vagy vegyértékkötés;

X jelentése az N-terminálisán az Y csoporthoz kötődő köztes aminosavcsoport vagy legfeljebb hattagú köztes oligopeptid csoport, amelynek a C-terminálisán hidroxilcsoport vagy vegyértékkötés lehet; ahol az aminosavak jelentése: Gly, Ala, Leu, Ile, Val, Phe, Tyr, Ahx, Pro, Arg, His;

A jelentése láncvégi vagy láncközi szabad aminosocsoportot tartalmazó és ezen keresztül r = 0 esetén közvetlenül Y-hoz, r nagyobb, mint 0 esetén az X csoport C-terminálisához kötött natív GnRH hormon vagy annak farmakológiailag aktív analógja;

r jelentése egész szám, amelynek értéke nullától 0,2 n-ig terjed;

k jelentése egész szám, amelynek értéke legfeljebb r-rel megegyező;

z jelentése egész szám, amelynek értéke 0 és (n-r) közé esik;

u jelentése egész szám, amelynek értéke n és 2n-r-z közé esik;

csoporthatását megnövekedett értékben és időben elnyújtva mutatják.

Ugyancsak a találmány tárgyát képezik az (I) általános képletű  
vegyülékek és sóikat hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények.

T S7/5/ALL

7/5/1

DIALOG(R)File 345:Inpadoc/Fam.& Legal Stat  
(c) 2002 EPO. All rts. reserv.

13974433

Document Type: Nobiblio (No bibliographic data)

7/5/2

DIALOG(R)File 345:Inpadoc/Fam.& Legal Stat  
(c) 2002 EPO. All rts. reserv.

13243724

Basic Patent (No,Kind,Date): HU 9402329 A0 19941028 <No. of Patents: 010>

PATENT FAMILY:

AUSTRALIA (AU)

Patent (No,Kind,Date): AU 9533616 A1 19960307

NOVEL GNRH ANALOGUES WITH ANTITUMOUR EFFECTS AND PHARMACEUTICAL  
COMPOSITIONS THEREOF (English)

Patent Assignee: SANDOR LOVAS; RICHARD F MURPHY; GEZA TOTH; ADRIENN  
KALNAY; DEZSO GAAL; ISTVAN PALYI; GIZELLA TURI; BORBALA VINCZE; IMRE  
MEZO; HENRIETTA TANAI; ZSOTT VADASZ; ISTVAN TEPLAN; JANOS SEPRODI

Author (Inventor): LOVAS SANDOR; MURPHY RICHARD F; TOTH GEZA; KALNAY  
ADRIENN; GAAL DEZSO; PALYI ISTVAN; TURI GIZELLA; VINCZE BORBALA; MEZO  
IMRE; TANAI HENRIETTA; VADASZ ZSOTT; TEPLAN ISTVAN; SEPRODI JANOS

Priority (No,Kind,Date): HU 949402328 A 19940810; HU 949402329 A  
19940810; WO 95US10054 W 19950809

Applic (No,Kind,Date): AU 9533616 A 19950809

IPC: \* A61K-038/00; C07K-005/00; C07K-007/00; C07K-017/00

Derwent WPI Acc No: \* C 96-139455

Language of Document: English

CANADA (CA)

Patent (No,Kind,Date): CA 2173727 AA 19960222

NOVEL GNRH ANALOGUES WITH ANTITUMOUR EFFECTS AND PHARMACEUTICAL  
COMPOSITIONS THEREOF (English; French)

Patent Assignee: LOVAS SANDOR (US); MURPHY RICHARD F (US); TOTH GEZA  
(HU); KALNAY ADRIENN (HU); GAAL DEZSO (HU); ISTVAN PALYI (HU);  
TURI GIZELLA (HU); BORBALA VINCZE (HU); MEZO IMRE (HU); TANAI  
HENRIETTA (HU); VADASZ ZSOTT (HU); TEPLAN ISTVAN (HU); SEPRODI  
JANOS (HU); SZABO EDIT Z (HU); PATO JANOS (HU); MORA MELINDA (HU)

Author (Inventor): LOVAS SANDOR (US); MURPHY RICHARD F (US); TOTH  
GEZA (HU); KALNAY ADRIENN (HU); DAAL DEZSO (HU); PALYI ISTVAN  
(HU); TURI GIZELLA (HU); VINCZE BORBALA (HU); MEZO IMRE (HU);  
TANAI HENRIETTA (HU); VADASZ ZSOTT (HU); TEPLAN ISTVAN (HU);  
SEPRODI JANOS (HU); SZABO EDIT Z (HU); PATO JANOS (HU); MORA  
MELINDA (HU)

Priority (No,Kind,Date): HU 949402328 A 19940810; HU 949402329 A  
19940810

Applic (No,Kind,Date): CA 2173727 A 19950809

IPC: \* C07K-007/23; C07K-007/06; C07K-017/08; C08F-222/02; C08F-226/10  
; C08F-008/00; A61K-038/09; A61K-047/48

Derwent WPI Acc No: \* C 96-139455

Language of Document: English

EUROPEAN PATENT OFFICE (EP)

Patent (No,Kind,Date): EP 728012 A1 19960828

NOVEL GNRH ANALOGUES WITH ANTITUMOUR EFFECTS AND PHARMACEUTICAL

COMPOSITIONS THEREOF (English; French; German)

Patent Assignee: LOVAS SANDOR (US); MURPHY RICHARD F (US); TOTH GEZA (HU); KALNAY ADRIENN (HU); GAAL DEZSO (HU); PALYI ISTVAN (HU); TURI GIZELLA (HU); VINCZE BORBALA (HU); MEZO IMRE (HU); TANAI HENRIETTA (HU); VADASZ ZSOLT (HU); TEPLAN ISTVAN (HU); SEPRODI JANOS (HU)

Author (Inventor): LOVAS SANDOR (US); MURPHY RICHARD F (US); TOTH GEZA (HU); KALNAY ADRIENN (HU); GAAL DEZSO (HU); PALYI ISTVAN (HU); TURI GIZELLA (HU); VINCZE BORBALA (HU); MEZO IMRE (HU); TANAI HENRIETTA (HU); VADASZ ZSOLT (HU); TEPLAN ISTVAN (HU); SEPRODI JANOS (HU)

Priority (No,Kind,Date): HU 949402328 A 19940810; HU 949402329 A 19940810; WO 95US10054 W 19950809

Applic (No,Kind,Date): EP 95930123 A 19950809

Designated States: (National) DE; FR; GB; IT

IPC: \* A61K-038/00; C07K-005/00; C07K-007/00; C07K-017/00

CA Abstract No: \* 125(07)087217X

Derwent WPI Acc No: \* C 96-139455

Language of Document: English

Patent (No,Kind,Date): EP 728012 A4 19981223

NOVEL GNRH ANALOGUES WITH ANTITUMOUR EFFECTS AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS THEREOF (English; French; German)

Patent Assignee: LOVAS SANDOR (US); MURPHY RICHARD F (US); TOTH GEZA (HU); KALNAY ADRIENN (HU); GAAL DEZSO (HU); PALYI ISTVAN (HU); TURI GIZELLA (HU); VINCZE BORBALA (HU); MEZO IMRE (HU); TANAI HENRIETTA (HU); VADASZ ZSOLT (HU); TEPLAN ISTVAN (HU); SEPRODI JANOS (HU)

Author (Inventor): LOVAS SANDOR (US); MURPHY RICHARD F (US); TOTH GEZA (HU); KALNAY ADRIENN (HU); GAAL DEZSO (HU); PALYI ISTVAN (HU); TURI GIZELLA (HU); VINCZE BORBALA (HU); MEZO IMRE (HU); TANAI HENRIETTA (HU); VADASZ ZSOLT (HU); TEPLAN ISTVAN (HU); SEPRODI JANOS (HU)

Priority (No,Kind,Date): HU 949402328 A 19940810; HU 949402329 A 19940810; WO 95US10054 W 19950809

Applic (No,Kind,Date): EP 95930123 A 19950809

Designated States: (National) DE; FR; GB; IT

IPC: \* A61K-038/00; C07K-005/00; C07K-007/00; C07K-017/00

CA Abstract No: \* 125(07)087217X

Derwent WPI Acc No: \* C 96-139455

Language of Document: English

HUNGARY (HU)

Patent (No,Kind,Date): HU 9402329 A0 19941028

NEW CONIUGATES OF PHARMACEUTICALLY ACTIVE POLYPEPTIDES WITH ENHANCED AND PROLONGUED ACTIVITY AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING THEM (English)

Patent Assignee: MTA KUTATAS ES SZERVEZETEMZSO (HU)

Priority (No,Kind,Date): HU 949402329 A 19940810

Applic (No,Kind,Date): HU 949402329 A 19940810

CA Abstract No: \* 125(07)087217X

Derwent WPI Acc No: \* C 96-139455

Language of Document: Hungarian

Patent (No,Kind,Date): HU 9503406 A0 19960129

INTERMEDIATES FOR PRODUCING PHARMACOLOGICALLY ACTIVE CONJUGATES (English)

Patent Assignee: ORSZAGOS ONKOLOGIAI INTEZET (HU); MTA KUTATASSZERVEZESI INTEZET (HU); MTA KOEZPONTI KEMIAI KUTATOINT (HU); UNIV CREIGHTON (US)

Author (Inventor): VINCZE BORBALA (HU); PATO JANOS (HU); TURI GIZELLA (HU); GAAL DEZSOE (HU); MORA MELINDA (HU); SZABO Z EDIT

(HU); KALNAY ADRIENN (HU); MEZOE IMRE (HU); PALYI ISTVAN (HU);  
SEPROEDI JANOS (HU); TEPLAN ISTVAN (HU); VADASZ ZSOLT (HU); LOVAS  
SANDOR (US); MURPHY RICHARD F (US)  
Priority (No,Kind,Date): HU 949402329 A 19940810  
Applic (No,Kind,Date): HU 959503406 A 19940810  
Language of Document: Hungarian  
Patent (No,Kind,Date): HU 212661 B1 19961128  
NEW ANTITUMOR GNRH ANALOGS AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING  
THEM (English)  
Patent Assignee: MTA TAMOGATOTT KUTATOHELYEK IR (HU); ORSZAGOS  
ONKOLOGIAI INTEZET (HU); UNIV CREIGHTON (US); MTA SZEGEDI BIOLOG  
KOEZPONT (HU)  
Author (Inventor): MEZOE IMRE (HU); LOVAS SANDOR (US); MURPHY  
RICHARD F (US); PALYI ISTVAN (HU); VINCZE BORBALA (HU); TEPLAN  
ISTVAN (HU); GAAL DEZSOE (HU); SEPROEDI JANOS (HU); VADASZ ZSOLT  
(HU); TOTH GEZA (HU); KALNAY ADRIENN (HU); TURI GIZELLA (HU);  
TANAI HENRIETTA (HU)  
Priority (No,Kind,Date): HU 949402328 A 19940810  
Applic (No,Kind,Date): HU 949402328 A 19940810  
IPC: \* C07K-007/06; A61K-033/08  
CA Abstract No: \* 125(07)087217X  
Derwent WPI Acc No: \* C 96-139455  
Language of Document: Hungarian  
Patent (No,Kind,Date): HU 212662 B1 19961128  
NEW CONIUGATES OF PHARMACEUTICALLY ACTIVE POLYPEPTIDES WITH ENHANCED  
AND PROLONGUED ACTIVITY AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING  
THEM (English)  
Patent Assignee: UNIV CREIGHTON (US); MTA KOEZPONTI KEMIAI KUTATOINT  
(HU); MTA TAMOGATOTT KUTATOHELYEK IR (HU); ORSZAGOS ONKOLOGIAI  
INTEZET (HU)  
Author (Inventor): PATO JANOS (HU); LOVAS SANDOR (US); MURPHY  
RICHARD F (US); MORA MELINDA (HU); PALYI ISTVAN (HU); VINCZE  
BORBALA (HU); GAAL DEZSOE (HU); MEZOE IMRE (HU); TEPLAN ISTVAN  
(HU); KALNAY ADRIENN (HU); SEPROEDI JANOS (HU); TURI GIZELLA (HU);  
VADASZ ZSOLT (HU); SZABO Z EDIT (HU)  
Priority (No,Kind,Date): HU 949402329 A 19940810  
Applic (No,Kind,Date): HU 949402329 A 19940810  
IPC: \* C08F-226/10; C07K-004/00; A61K-047/32; A61K-038/02  
CA Abstract No: \* 125(07)087217X  
Derwent WPI Acc No: \* C 96-139455  
Language of Document: Hungarian

JAPAN (JP)

Patent (No,Kind,Date): JP 9508142 T2 19970819  
Priority (No,Kind,Date): HU 949402328 A 19940810; HU 949402329 A  
19940810; WO 95US10054 W 19950809  
Applic (No,Kind,Date): JP 95507451 A 19950809  
IPC: \* A61K-038/00; A61K-047/48; C07K-014/575; C07K-017/00;  
C07K-105-00  
CA Abstract No: \* 125(07)087217X  
Derwent WPI Acc No: \* C 96-139455  
Language of Document: Japanese

*Attached*

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION, PCT (WO)

Patent (No,Kind,Date): WO 9604927 A1 19960222  
NOVEL GNRH ANALOGUES WITH ANTITUMOUR EFFECTS AND PHARMACEUTICAL  
COMPOSITIONS THEREOF (English)  
Patent Assignee: LOVAS SANDOR (US); MURPHY RICHARD F (US); TOTH GEZA  
(HU); KALNAY ADRIENN (HU); GAAL DEZSO (HU); PALYI ISTVAN (HU);  
TURI GIZELLA (HU); VINCZE BORBALA (HU); MEZO IMRE (HU); TANAI

HENRIETTA (HU); VADASZ ZSOTT (HU); TEPLAN ISTVAN (HU); SEPRODI  
JANOS (HU)  
Author (Inventor): LOVAS SANDOR (US); MURPHY RICHARD F (US); TOTH  
GEZA (HU); KALNAY ADRIENN (HU); GAAL DEZSO (HU); PALYI ISTVAN  
(HU); TURI GIZELLA (HU); VINCZE BORBALA (HU); MEZO IMRE (HU);  
TANAI HENRIETTA (HU); VADASZ ZSOTT (HU); TEPLAN ISTVAN (HU);  
SEPRODI JANOS (HU)  
Priority (No,Kind,Date): HU 949402328 A 19940810; HU 949402329 A  
19940810  
Applic (No,Kind,Date): WO 95US10054 A 19950809  
Designated States: (National) AM; AT; AU; BB; BG; BR; BY; CA; CH; CN;  
CZ; DE; DK; EE; ES; FI; GB; GE; HU; JP; KE; KG; KP; KR; KZ; LK; LR;  
LT; LU; LV; MD; MG; MN; MW; MX; NO; NZ; PL; PT; RO; RU; SD; SE; SI;  
SK; TJ; TT; UA; US; UZ; VN (Regional) KE; MW; SD; SZ; UG; AT; BE;  
CH; DE; DK; ES; FR; GB; GR; IE; IT; LU; MC; NL; PT; SE; BF; BJ; CF;  
CG; CI; CM; GA; GN; ML; MR; NE; SN; TD; TG  
Filing Details: WO 130000 With international search report; Before  
expiration of time limit for amending the claims and to be  
republished in the event of the receipt of the amendments  
IPC: \* A61K-038/00; C07K-005/00; C07K-007/00; C07K-017/00  
CA Abstract No: \* 125(07)087217X; 125(07)087217X  
Derwent WPI Acc No: \* C 96-139455; C 96-139455  
Language of Document: English

?